



Heart infusion agar 使用による平板 cup 法によつて測定した。検定菌としては *B. subtilis* ATCC 6633 を使用した。なお standard curve は buffer dilution によりえている (Table 2)。表のように、注射後 30 分での血清中濃度の平均は 6.95 mcg/ml (7 例平均) であり、その時の扁桃組織内移行は 0.39 mcg/g (4 例平均)、上顎洞粘膜内移行は 0.61 mcg/g (2 例平均) であつた。表中 \* 印を附した例では術中出血が比較的多く、上顎洞粘膜をとり出すまでにやや時間がかかつており、そのために、同時に採血した血清中濃度が他の例より低い値となつたものと

考えている。ちなみに、ブリストル社発表の成績によれば筋注時血清中濃度の peak は 30 分にみられ、half time は 40 分とのことである。

#### 4. 臨床成績

耳鼻咽喉科領域急性感染症、細菌感染による急性増悪症および細菌感染が原因と考えられる発熱と舌癌のために入院加療中の梅毒を対象として本剤の臨床治験を行なつた (Table 3, 4)。

臨床治験を行なつた 11 例中、経過を観察しえた 9 例

Table 2 Concentration of cephalirin sodium (CEP) in tonsil, maxillary mucosa and serum  
(diffused for 24 hours at 4°C)

Case	Administration hour before operation	Dose	Concentration in serum	Concentration in tonsillar tissue	Concentration in maxillary mucosa
S. 26 yr. ♀	30	18	6.24 mcg/ml	0.24 mcg/g	— mcg/g
M. 33 ♂	//	//	9.60	0.1	—
*A. 26 ♀	//	//	0.85	—	0.24
O. 5 ♂	//	500mg	9.50	0.30	—
M. 5 ♀	//	//	8.40	0.93	—
A. 26 ♀	//	1g	5.50	—	0.98
T. 70 ♂	//	//	8.40	—	—

Only blood concentration was measured in case T (excision of nasal polypus).

Table 3 Therapeutic results of cephalirin sodium (CEP) (1)

Case	Diagnostic name	Dosis	Transition of course			Effect	Side effect	Remarks
K. 5 yr. ♀	Acute lacunar tonsillitis	500 mg × 4	pharyngodynia (++) <3rd> (-) <7th> (-)	Neomembrane (++) (+) (±)	38.9°C 36.3°C (-)	Remarkably effective	none	
*U. 22 // ♂	ditto	1 g × 2	pharyngodynia (+++) <3rd> (-)	neomembrane (++) (+)(-)	40°C	Unknown	//	Combined with other drugs
I. 52 // ♀	ditto	1 g × 5	pharyngodynia (+++) <3rd> (-) <5th> (-)	neomembrane (++) (+) (-)	37.2°C (-) (-)	Remarkably effective	//	
T. 24 // ♀	ditto	1 g × 4	pharyngodynia (+++) <3rd> (-) <5th> (-)	neomembrane (+++) (+) (-)	39.2°C (-) (-)	//	//	
F. 22 // ♂	Left peritonsillar abscess	1 g × 6	pharyngodynia (+++) <3rd> (++) <5th> (-)	neomembrane (±) (±) (-)	(+++) (+) (-)	Effective	//	Incised on 3rd day

Table 4 Therapeutic results of cephapirin sodium (CEP) (2)

Case	Diagnostic name	Dosis	Transition of course	Effect	Side effect	Remarks
S. 19 yr. ♀	Right ear congenital fistula, Suppuration	1 g × 1	Pus (++)	Unknown	none	Interrupted
M. 22 // ♀	Nasal furuncle	1 g × 2	Swelling (++) pain (++) <2nd> (-) (-)	Remarkably effective	''	
M. 28 // ♀	Both chronic sinusitis, Acute exacerbation	1 g × 2	Myxopurulent, rhinorrhea (++) <3rd> (+) <6th> (±)	Effective	''	
*S. 54 // *♀	Malignant tumor of larynx	2 g × 15	Pyrexia 39.2°C <6th> 36.4°C	''	''	Death
T. 82 // ♂	Lingual cancer (Syphilis)	2 g × 15	WASSERMANN'S reaction (+++) TPHA: 80 dil/s	Unknown	''	Changed hospital, Death
N.	Tonsillar reticulosarcoma	2 g × 9	pyrexia 38.4°C <5th> 36.6°C	Effective	''	

については、\*印を付した1例をのぞいてはすべて著効または有効であった。この例はあやまつて他の抗生剤を同時に内服させた例で、結果的には著効をおさめていたが、本剤だけの効果とするには問題があるので不明とした。\*\*印を付した症例は喉頭癌の末期に近く、気管切開をほどこしてカニューレを挿入してある症例で、ときどき熱発があつて、気管切開孔から黄色粘稠な分泌物を喀出することがつづくため、点滴中に Cephalothin (CET) を混入することで解熱させていたが、そのうち CET 混入の点滴静注により全身に強い痒痒感をうつたえるようになってきた。このため CET による副作用と考えざるをえなくなり、困つていたとき、たまたま本剤が手許にあり、その 2 mg/ml 液を作成して皮内反応をこころみたと、反応が陰性であつたため本剤による治療が可能になつた症例である。

### 5. 考 按

本剤の検討を行なうにあつては、私たちは本剤が Cephalosporin 系の薬剤であり、したがつて過敏性反応が充分考えられるため、投与にさきだち全例に 2 mg/ml 液 0.02 ml による皮内反応をほどこした。組織移行を検討した7例、臨床治験を行なつた 11 例のいずれにも本剤の副作用とみられるものがまつたく出てこなかつた

のはこのためと考へていただいでさしつかえない。

なお、皮内反応の判定基準は厳密にすぎたかもわからないが、10×10 mm 以上の発赤を示したものを陽性とした。このため皮内反応の段階で除外した例が数例あることを附記する。

これらの即時型の過敏性反応は Penicillin の 6-Aminopenicillanic acid におけると同様に、Cephalosporin 系薬剤がその核に 7-Aminocephalosporanic acid をもつことに起因すると考えられるが、臨床治験の中で、CET に対して過敏性反応を示しながら本剤に対してはこういう反応を呈さなかつた例が1例存在したことは、きわめて興味深い事実と考えられる。

### 参 考 文 献

- 1) JUDITH AXELROD, et al.: Cephapirin: *In vitro* antibacterial spectrum. *Applied Microbiology* 22(5) 904~908 (1971)
- 2) STANLEY J. BODNER, et al.: Clinical and *in vitro* evaluation of cephapirin: a new parenteral cephalosporin. *Amer. J. Med. Sci.* 263 (1) 43~51 (1972)

---

LABORATORY AND CLINICAL STUDY ON CEPHAPIRIN SODIUM  
(CEP) IN OTO-RHINO-LARYNGOLOGIC FIELD

TERUO TAKASU, SHUNKICHI BABA, TSUTOMU MAMIYA,  
JUN HONDOH, KENJI WADA and TSUTOMU HATANO

Department of Oto-rhino-laryngology, Nagoya City University, Medical School  
(Director: Prof. T. TAKASU)

From the laboratory and clinical studies on cephalapirin soduim (CEP), the following results were obtained.

1. The sensitivity test of CEP was measured by the plate dilution method on 27 strains isolated from pathological materials in our clinic. *Staphylococcus aureus* strains were all inhibited the growth up to 3.12 mcg/ml of CEP. *Pseudomonas* species were highly resistant to this antibiotic as well as other cephalosporins.
2. Single intramuscular injection of CEP (1 g to adults and 500 mg to children) produced serum concentration of 6.95 mcg/ml on an average in 7 patients.
3. Tissue concentrations of CEP were measured by thin layer cup method in tonsils and sinus membranes. An average tissue level 30 minutes after an intramuscular injection (1 g to adults and 500 mg to children), was 0.39 mcg/g in tonsils and 0.61 mcg/g in sinus membranes.
4. CEP was clinically used in 11 cases of ear, nose and throat infections, and the effectiveness was obtained in 81.8% of them.